

HB181130

## BI 2536

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
BI 2536	51105ES08	5mg
BI 2536	51105ES10	10mg

### 产品描述

BI 2536 是一种新型、强效的、高选择性 PLK1 抑制剂 ( $IC_{50}=0.83$  nM), 也可以抑制 PLK2 ( $IC_{50}=3.5$  nM)和 PLK3 ( $IC_{50}=9.0$  nM)。BI 2536 诱导细胞有丝分裂阻断, 并诱导癌细胞凋亡, 另外, 还可以抑制裸鼠体内移植瘤生长, 诱导肿瘤衰退。BI 2536 作用于 AML 细胞表现出强效的抗增殖作用。

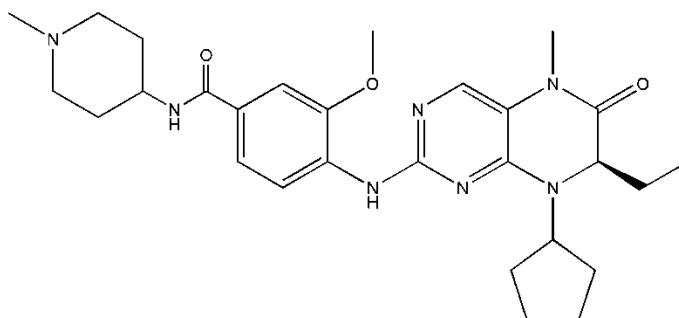
目前, BI 2536 已用于临床 Phase I/II 研究。

**【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】**

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	BI2536
化学名 (Chemical Name)	(R)-4-(8-cyclopentyl-7-ethyl-5-methyl-6-oxo-5,6,7,8-tetrahydropteridin-2-ylamino)-3-methoxy-N-(1-methylpiperidin-4-yl)benzamide
靶点 (Target)	PLK1
CAS 号 (CAS NO.)	755038-02-9
分子式 (Molecular Formula)	$C_{28}H_{39}N_7O_3$
分子量 (Molecular Weight)	521.66
外观 (Appearance)	结晶性粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO、乙醇

### 结构式 (Structure)



### 运输与保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于  $-20$  °C, 有效期 2 年。溶于 DMSO、乙醇。建议分装后  $-20$  °C 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

### 注意事项

- 1) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

## 使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件(如实验目的, 细胞种类, 培养特性等)进行摸索和优化。】

## 相关实验(数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

### (一) 细胞实验(体外研究)

为检测 BI 2536 在细胞内的作用, 用不同浓度的 BI 2536(0-1 $\mu$ M)孵育 HeLa 细胞, BI 2536 诱导细胞中 4N DNA 浓度累积, 细胞周期停滞在 G2 或有丝分裂期。<sup>[1]</sup>

### (二) 动物实验(体内研究)

体内实验中, HCT116 移植瘤小鼠静脉注射 40-50 mg/kg BI 2536 (40mg/kg, 每周 1 次; 50 mg/kg, 每周 2 次), BI 2536 有效作用于移植瘤, 完全抑制小鼠中 HCT 116 癌细胞生长, 引起明显的肿瘤衰退。<sup>[1]</sup>

## 参考文献

- [1] Steegmaier M, et al. BI 2536, a Potent and Selective Inhibitor of Polo-like Kinase 1, Inhibits Tumor Growth In Vivo. *Curr Biol*, 17(4): 316-322 (2007).
- [2] Lu B, et al. The Plk1 Inhibitor BI 2536 Temporarily Arrests Primary Cardiac Fibroblasts in Mitosis and Generates Aneuploidy In Vitro. *PLoS ONE* 5(9): e12963 (2010).
- [3] Patrick Schöffski, et al. Polo-Like Kinase (PLK) Inhibitors in Preclinical and Early Clinical Development in Oncology. *The Oncologist* 14(6): 559-570 (2009).
- [4] Lee KH, et al. Polo-Like Kinase-1 (Plk-1) Inhibitor BI 2536 Induces Mitotic Arrest and Apoptosis in Vivo: First Demonstration of Target Inhibition in the Bone Marrow of AML Patients. *Blood* 112: 2641 (2008).